

SLOWLY RELEASING SOFT CAPSULE PREPARATION

Patent number: JP63246322
Publication date: 1988-10-13
Inventor: FUKAZAWA TOSHIHIDE; others: 02
Applicant: TOYO KAPUSERU KK
Classification:
- **international:** A61K9/48
- **european:**
Application number: JP19870080744 19870331
Priority number(s):

Abstract of JP63246322

PURPOSE: To obtain the titled preparation exhibiting excellent slowly releasing effect, by dispersing an active drug in a gel matrix formed by the use of lecithin and encapsulating the obtained liquid in a gelatin capsule.

CONSTITUTION: (Hydrogenated) lecithin is dissolved in an oleophilic base (e.g. animal or vegetable food oil) at 60-70 deg.C, allowed to cool, added with a hydrophilic base (e.g. polyethylene glycol, polyhydric alcohol or sugars) and thoroughly stirred to obtain a gelled product. An active drug is suspended in the gel and the suspension is filled in a gelatin capsule by conventional method to obtain the objective soft capsule preparation. As an alternative method, the active drug is dissolved in the base beforehand and a gel is formed from the solution according to the above steps.

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide

BEST AVAILABLE COPY

⑫ 公開特許公報(A)

昭63-246322

⑬ Int.Cl.⁴

A 61 K 9/48

識別記号

庁内整理番号

S-6742-4C

⑭ 公開 昭和63年(1988)10月13日

審査請求 未請求 発明の数 1 (全3頁)

⑮ 発明の名称 徐放性軟カプセル製剤

⑯ 特 願 昭62-80744

⑰ 出 願 昭62(1987)3月31日

⑱ 発 明 者	深 澤 利 英	静岡県富士郡芝川町羽鮒1172
⑲ 発 明 者	高 橋 雅 人	静岡県富士宮市淀師605の5
⑳ 発 明 者	望 月 弘 之	静岡県富士宮市中里東町567
㉑ 出 願 人	東洋カプセル株式会社	静岡県富士宮市中里東町560番地
㉒ 代 理 人	弁理士 糟 谷 安	

明 細 書

1. 発明の名称

徐放性軟カプセル製剤

2. 特許請求の範囲

1. 有効成分と軟カプセル製剤製造に常用される親水性物質、油性物質に加えて水素添加したまたは水素添加しないレシチンを添加した配合物を内容物となし、これをセラチンの配合物よりなる皮膜部で被包してなる徐放化セラチン軟カプセル製剤。

2. 親水性物質としてポリエチレングリコール、多価アルコールおよび糖類そして油性物質として動植物性食用油を用いる特許請求の範囲第1項記載の徐放化セラチン軟カプセル製剤。

3. 発明の詳細な説明

本発明は水素添加をしたまたは水素添加しないレシチンを用いてゲル状のマトリックスを生成し、このマトリックス中に所期する有効薬物を分散

させた内容物をセラチンカプセルに包み込むことによって得られる製剤を提供することに関し、この軟カプセル製剤は徐放性を有することで特長づけられるものである。

現在、徐放性製剤は錠剤、硬カプセル剤などの剤形のものが主流をなしているが、錠剤においては徐放化にあたり徐放部を速放部で包み込んだものの、また硬カプセル剤では内容物をマイクロカプセル化するなどの高度な技術と複雑な製品工程が必要とされている。

しかし、本発明による徐放化は簡易な方法で確実な効果が得られるという特徴を有するものである。

本発明を説明すれば、親油性基剤にレシチンを60～70℃で溶解し、放冷後、親水性基剤を加え充分攪拌することによりゲル状生成物を得る。このゲル体に所期する薬物を懸濁あるいはあらかじめ基剤に溶解させておいてゲル体を生成する。これを常法に従いセラチンカプセルに充填させることにより目的とする軟カプセル剤を得るのであ

る。

本発明における親油性基剤としてはポリエチレングリコール、糖類、多価アルコール類を指し、油性基剤とは動植物性の食用油脂をいい、レシチンは水素添加したものを用いても製品の効果に左程の影響を及ぼさない。

本発明のゼラチン性皮膜で被包した軟カプセル剤は、その被包したことによっても徐放性が損われることなく、優れた徐放効果を発揮するものである。

以下に実施例をもって本発明を更に詳述する：

実施例1：ニフェジピン徐放性軟カプセル

下記する処方および配合量をもって常法により有効成分ニフェジピン徐放性軟カプセル製剤を製造した（内容物の各成分の数字は1カプセル中の含有量）。

処方

皮膜部

ゼラチン	100重量部
グリセリン	25 "

D-ソルビトール 3.5重量部

精製水 適量

内容液部

成分	検体	D	E	F
ポリエチレングリコール		0	120	130
スクワレン		150	120	120
水素添加レシチン		130	40	30
塩酸ニカルジピン		20	20	20

上表の検体を日本薬局方規定の溶出試験を180分以上行なった結果の溶出パターンは添付図面の第2図に示される通りである。

実施例3：

前記した実施例1および2の検体の中で添付図面に示される成績により有用性の認められた検体CおよびFを用いた加速試験

検体CおよびFの各3ロットにつきそれぞれ2群に分け、一方は室温で貯蔵し、他方は40℃±1℃、相対湿度75%±5%の高温高湿条件下に貯蔵し、経時変化を観察した。すなわち、各試験

D-ソルビトール

3.5重量部

精製水

適量

内容液部

成分	検体	A	B	C
ポリエチレングリコール		0	120	130
スクワレン		150	120	120
水素添加レシチン		130	40	30
ニフェジピン		20	20	20

上表の検体を日本薬局方規定の溶出試験を

180分以上まで行なった溶出パターンは添付図面の第1図に示される通りである。

実施例2：塩酸ニカルジピン徐放性軟カプセル

下記する処方および配合量をもって常法により有効成分塩酸ニカルジピン徐放性軟カプセル製剤を製造した。

処方

皮膜部

ゼラチン	100重量部
グリセリン	25 "

は共に日本薬局方に準拠し、3ロットにつきそれぞれ3回ずつ試験を行ない平均値を算出した。いずれの試験も6カ月間の保存により有意な変化が見られなかったことは下表で示されるところである。

第1表 重量偏差試験 単位：%

検体	C		F	
	室温	高温	室温	高温
0	300.6	300.6	299.8	299.8
1	300.1	300.9	299.6	300.1
3	299.7	301.2	299.4	300.3
6	300.3	301.8	299.7	300.1

第2表 溶出試験 単位：%

検体	C			F		
	60分	120分	180分	60分	120分	180分
0	58.3	50.9	60.8	41.2	53.9	60.7
1	39.1	51.3	61.4	42.0	53.8	61.1
3	38.9	51.0	61.2	41.8	54.0	60.9
6	39.1	52.1	60.9	42.2	53.7	61.3

第3表 高温高湿保存試験 単位：%

経月数	検体	C			F		
		60分	120分	180分	60分	120分	180分
0		38.3	50.9	60.8	41.2	53.9	60.7
1		39.1	51.3	61.4	42.0	53.8	61.1
3		38.1	51.0	61.2	41.8	54.0	60.9
6		39.1	52.1	60.9	42.2	53.7	61.3

第4表 定量試験 単位：%

経月数	検体	C		F	
		室温	高温	室温	高温
0		100.2	100.2	99.9	99.9
1		100.6	100.0	99.4	99.6
3		100.3	100.3	99.8	99.7
6		99.9	99.8	99.3	99.5

以上の第1表ないし第4表に示される成績より
して本発明の徐放性軟カプセル剤の効果は充分
に実証された。

4. 図面の簡単な説明

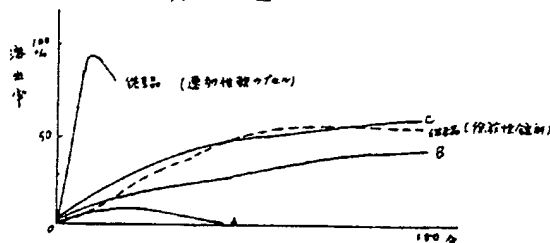
第1図は従来品との比較における有効成分としてニフェジピンを含有させた本発明A、BおよびC製剤の溶出試験成績を示す線図（平面図）、第2図は従来品との比較における有効成分として塩酸ニカルジピンを含有させた本発明のD、EおよびF製剤の溶出試験成績を示す線図（平面図）。

図中、A、B、C、D、EおよびFはそれぞれの処方番号の本発明徐放性軟カプセル剤についての成績を示すものである。

（特許出願人 東洋カプセル株式会社）

（代理人 弁理士 糟谷 安）

第1図



第2図

